


# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054239	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/000237	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 15.01.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 22.01.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D333/22		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags  22.11.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  30.12.2004	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Stroeter, T  Tel. +49 89 2399-8088	



**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT  
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

 Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/000237

**Feld Nr. I Grundlage des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
  - ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
    - ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
    - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
    - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile\*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

**Beschreibung, Seiten**

1-4 in der ursprünglich eingereichten Fassung

**Ansprüche, Nr.**

1-8 in der ursprünglich eingereichten Fassung

**Zeichnungen, Blätter**

1/1 in der ursprünglich eingereichten Fassung

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
  - ☐ Beschreibung: Seite
  - ☐ Ansprüche: Nr.
  - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
  - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen. (Regel 70.2 c)).
  - ☐ Beschreibung: Seite
  - ☐ Ansprüche: Nr.
  - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
  - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
  - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

\* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

---

**Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

---

1. Feststellung .  
Neuheit (N) Ja: Ansprüche 1-8  
Nein: Ansprüche  
Erfinderische Tätigkeit (IS) Ja: Ansprüche 1-8  
Nein: Ansprüche  
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) Ja: Ansprüche: 1-8  
Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

**siehe Beiblatt**

---

**Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen**

---

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)  
und / oder  
2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

**siehe Beiblatt**

**Zu Punkt V**

**Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit  
und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung  
dieser Feststellung**

**1 Der Gegenstand der unabhängigen Patentansprüche**

Die vorliegende Anmeldung betrifft 3-Methylamino-1-(2-thienyl)-1-propanon und seine Säureadditionssalze (unabhängiger Anspruch 1) sowie die Verwendung dieser Verbindungen (unabhängiger Anspruch 3) als Intermediate in der Darstellung von Duloxetin bzw. Verfahren hierzu (unabhängiger Anspruch 6).

Anmerkung: Produktanspruch 2 wurde vermutlich versehentlich als unabhängiger Anspruch formuliert und sollte als abhängig von Anspruch 1 formuliert werden.

**2 Dokumente zum Stand der Technik**

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen. Die angegebene Numerierung der Dokumente wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:

D1: WO 2004/020391 A (MERCK PATENT GMBH ; NIESERT CLAUS-PETER (DE); FABIAN KAI (DE); KRALIK) 11. März 2004

D2: EP-A-0 457 559 (LILLY CO ELI) 21. November 1991

D3: LIU H ET AL: "CHEMO-ENZYMATIC SYNTHESIS OF THE ANTIDEPRESSANT DULOXETINE AND IST ENANTIOMER" CHIRALITY, WILEY-LISS, NEW YORK, US, Bd. 12, Nr. 1, 2000, Seiten 26-29

Zu D1 bitte siehe Punkt VI. D1 wird im Folgenden nicht weiter berücksichtigt.

**3    Neuheit (Artikel 33(2) PCT) und Erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT)**

Die in den Ansprüchen 1 und 2 beanspruchten Verbindungen sind neu gegenüber D2, D3 und sonstigen Dokumenten zum Stand der Technik im Sinne von Regel 64.1(b) PCT. Gleiches gilt demgemäß für die Verwendungs- bzw. Verfahrensansprüche 3 bis 8, welche die Verwendung dieser Verbindungen als Intermediate in der Darstellung von Duloxetin beinhalten.

Die vorliegenden Ansprüche 1 bis 8 sind erfinderisch, da die aus dem nächstliegenden Stand der Technik D2 und D3 bekannten Verfahren unterschiedliche Syntheserouten offenbaren: Im Stand der Technik wird stets zunächst die Alkoholfunktion durch Reduktion des entsprechenden Carbonylprecursors gebildet bevor die Monomethyl-Aminogruppe eingeführt wird. Demnach wurde vorliegende technische Aufgabe, ein alternatives Verfahren zur Darstellung von Duloxetin bereitzustellen in nicht-naheliegender, erfinderischer Weise gelöst.

**4    Gewerbliche Anwendbarkeit (Artikel 33(4) PCT)**

in der vorliegenden Anmeldung dargelegten Patentansprüche 1 bis 8 sind gewerblich anwendbar gemäß Artikels 33(4) PCT.

**Zu Punkt VI**

**Bestimmte angeführte Unterlagen**

Obwohl das Dokument D1 kein Stand der Technik im Sinne von Regel 64.1(b) PCT ist, wird darauf hingewiesen, daß dieses Dokument in den Ansprüchen 1 und 2 beanspruchten Verbindungen vorwegnimmt.

Es wird darauf hingewiesen, daß keine Prüfung hinsichtlich der Frage zur Gültigkeit der Priorität, durchgeführt worden ist.